

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

L21 ANSWER 173 OF 174 WPIDS COPYRIGHT 2002 DERWENT INFORMATION LTD  
AN 1987-084155 [12] WPIDS

DNC C1987-035264

TI Cosmetic material for **skin whitening** - contains  
hydroxy **cinnamic** acid and weakly basic (in)organic salt.

DC D21 E14

PA (KAOS) KAO CORP

CYC 1

PI JP 62036305 A 19870217 (198712)\* 4p

ADT JP 62036305 A JP 1985-174907 19850808

PRAI JP 1985-174907 19850808

AB JP 62036305 A UPAB: 19930922

0.1-20 Wt.% of 4-hydroxy **cinnamic** acid, as effective component,  
and weakly basic inorganic salt or weakly basic organic salt are  
compounded.

USE - The material has good **skin whitening** and  
sun-burn prevention due to the 4-hydroxy **cinnamic** acid, which  
prevents melanine generation and is compounded in large quantity and  
stably.

0/0

TI Cosmetic material for **skin whitening** - contains  
hydroxy **cinnamic** acid and weakly basic (in)organic salt.

AB JP 62036305 UPAB: 19930922

0.1-20 Wt.% of 4-hydroxy **cinnamic** acid, as effective component,  
and weakly basic inorganic salt or weakly basic organic salt are  
compounded.

USE - The material has good **skin whitening** and  
sun-burn prevention due to the 4-hydroxy **cinnamic** acid, which  
prevents melanine generation and is compounded in large quantity and  
stably.

0/0

CLIPPEDIMAGE= JP362036305A  
PAT-NO: JP362036305A  
DOCUMENT-IDENTIFIER: JP 62036305 A  
TITLE: COSMETIC

PUBN-DATE: February 17, 1987

INVENTOR-INFORMATION:

NAME  
HOTTA, HAJIME  
TO, HISAO

ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
KAO CORP	N/A

APPL-NO: JP60174907

APPL-DATE: August 8, 1985

INT-CL\_(IPC): A61K007/00; A61K007/44

ABSTRACT:

PURPOSE: To provide a cosmetic having excellent skin-beautifying effect and

anti-suntan effect and containing a large amount of 4-hydroxycinnamic acid stably as an active component, by adding a weakly basic inorganic salt or weakly basic organic acid salt as a neutralizing agent.

CONSTITUTION: A skin-beautifying and anti-suntan cosmetic containing (A) 0.1&sim;20wt% (preferably 0.5&sim;15%) 4-hydroxycinnamic acid and (B) a weakly basic inorganic salt or (C) a weakly basic organic acid salt. Although the

component A has excellent melanine-suppressing activity, it is a crystal having low solubility in water and is hardly soluble also in general oil for cosmetic. A large amount of the compound A can be compounded stably to a cosmetic by adding 1&sim;2mol of the compound B [e.g.  $MCIO$ ,  $MHCO<SB>3</SB>$  or  $M<SB>2</SB>CrO<SB>4</SB>$  ( $M$  is  $Na$  or  $K$ )] or component C (e.g. sodium acetate or potassium propionate) to 1mol of the component A.

COPYRIGHT: (C)1987,JPO&Japio

DERWENT-ACC-NO: 1987-084155

DERWENT-WEEK: 198712

COPYRIGHT 1999 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: Cosmetic material for skin whitening - contains hydroxy cinnamic acid

and weakly basic (in)organic salt

PATENT-ASSIGNEE: KAO CORP[KAOS]

PRIORITY-DATA: 1985JP-0174907 (August 8, 1985)

PATENT-FAMILY:

PUB-NO	PUB-DATE	LANGUAGE	PAGES
--------	----------	----------	-------

MAIN-IPC

JP 62036305 A	February 17, 1987	N/A	004	N/A
---------------	-------------------	-----	-----	-----

APPLICATION-DATA:

PUB-NO	APPL-DESCRIPTOR	APPL-NO
--------	-----------------	---------

APPL-DATE

JP62036305A	N/A	1985JP-0174907	August 8, 1985
-------------	-----	----------------	----------------

INT-CL\_(IPC): A61K007/00

ABSTRACTED-PUB-NO: JP62036305A

BASIC-ABSTRACT: 0.1-20 Wt.% of 4-hydroxy cinnamic acid, as effective component,

and weakly basic inorganic salt or weakly basic organic salt are compounded.

USE - The material has good skin whitening and sun-burn prevention due to the

4-hydroxy cinnamic acid, which prevents melanine generation and is compounded

in large quantity and stably.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

DERWENT-CLASS: D21 E14

CPI-CODES: D08-B09A; E10-C04B;

----- KWIC -----

DID:  
JP 62036305 A

## ⑫ 公開特許公報 (A) 昭62-36305

⑬ Int.Cl.<sup>4</sup>A 61 K 7/00  
7/44

識別記号

厅内整理番号

⑭ 公開 昭和62年(1987)2月17日

7306-4C  
7133-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全4頁)

⑮ 発明の名称 化粧料

⑯ 特願 昭60-174907

⑰ 出願 昭60(1985)8月8日

⑱ 発明者 堀 田 肇 船橋市印内3-20-1

⑲ 発明者 塙 久夫 埼玉県南埼玉郡宮代町宮代台1-20-15

⑳ 出願人 花王株式会社 東京都中央区日本橋茅場町1丁目14番10号

㉑ 代理人 弁理士 有賀 三幸 外2名

## 明細書

## 1. 発明の名称

化粧料

周囲の角化細胞に放出され、角化に伴つて脱落するため、一定の表皮内密度を保つている。

## 2. 特許請求の範囲

1. 4-ヒドロキシケイ皮酸0.1~20重量%と、弱塩基性無機塩又は弱塩基性有機酸塩を配合したことを特徴とする化粧料。

従つて、皮膚色は均一で、一年中ほとんど変化を認めない。しかし、紫外線、メラノサイト刺激ホルモン(MSH)、加齢等により、メラニン産生機能が亢進し、臨床的に皮膚の黒化が生じ、これが局部的に発生した場合、周囲の正常皮膚と明らかな差を生ずるため、しみ、そばかす等の色素斑となることがある。

## 3. 発明の詳細な説明

## 〔産業上の利用分野〕

本発明は4-ヒドロキシケイ皮酸を有効成分として配合した化粧料に関する。

これらしみ、そばかす、肝斑および日焼け後の色素沈着は、加齢に伴ない発生・増加し、あるいは消失しにくくなり、代償的な中高年令層の肌の悩みの一つとなつてゐる。

## 〔従来の技術〕

皮膚の色は主に表皮内メラニンの量によつて左右されるもので、このメラニンはメラノサイト内で常に一定の速度で產生された後、

而して、キロシナーゼ活性阻害作用を有し〔ジャーナル・オブ・ザ・ソサイエティー・

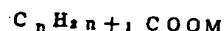
特開昭62-36305(2)

コスマチック・ケミカルズ (J. Soc. Cosmet. Chem. ) 25, 61~66 (1974) ]、メラニン抑制作用を有する化合物として4-ヒドロキシケイ皮酸が知られている。しかしながら、4-ヒドロキシケイ皮酸は、結晶性であり、それ自身では、水への溶解度が低く (0.069/100g)、また、一般の化粧料用油剤に対しても難溶性であるため、化粧料中に大量に配合することは困難であり、化粧料に対する適合性の点で問題があつた。

一方、4-ヒドロキシケイ皮酸の類似化合物である、4-メトキシケイ皮酸はトリエタノールアミン、トリス(ヒドロキシメチル)アミノメタン等のアンモニウムイオンで塩を形成させると、水溶性が著しく増加し、化粧

すなわち本発明は、4-ヒドロキシケイ皮酸0.1~2.0重量%と、弱塩基性無機塩又は弱塩基性有機酸塩を配合したことを特徴とする化粧料である。

本発明において、4-ヒドロキシケイ皮酸の中和剤として使用する弱塩基性無機塩としては、例えば $MgCO_3$ 、 $MgHCO_3$ 、 $MgCrO_4$ 、 $MgSO_4$ 、 $MgH_2O_4$ 、 $MgHPO_4$ 、 $Mg_2HPO_4$ 、 $Mg_2HP_2O_7$  (Mはナトリウム又はカリウムを示す)等が挙げられる。また弱塩基性有機酸塩としては、例えば次式



(式中、nは1~4の数を示し、Mは前記と同じ)

で表わされる酢酸、プロピオン酸、乳酸等の

料に適合しやすくなることが知られている (特公昭59-20663号、特開昭59-130209号)。しかしながら、上記4-ヒドロキシケイ皮酸のアンモニウム塩は、長期保存時に分離をうけ、変色、着色が著しく、また効果も低下し、化粧料として好ましいものではなかつた。

〔発明が解決しようとする問題〕

斯かる実状において、本発明者は4-ヒドロキシケイ皮酸を大量に、しかも安定に化粧料中に配合する方法について観察検討を重ねたところ、4-ヒドロキシケイ皮酸と、その中和剤として弱塩基性無機塩又は弱塩基性有機酸塩を配合すればこの目的が達成されることを見出し、本発明を完成した。

カルボン酸塩、安息香酸、乳酸等のナトリウム塩又はカリウム塩；次式



(式中、mは0~7の数を示し、Mは前記と同じ)

で表わされるシュウ酸、マロン酸、コハク酸、グルタル酸、アシピン酸、アセチル酸等のジカルボン酸塩、フマル酸、マレイン酸、タル酸、テレフタル酸、リンゴ酸、酒石酸等の二ナトリウム塩又は二カリウム塩；クエン酸、エチレンジアミン四酢酸の三ナトリウム塩又は三カリウム塩等が挙げられる。就中、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム、プロピオン酸ナトリウム、プロピオン酸カリウム、乳酸ナトリウム、乳酸カリウム、クエン酸三カリ

ウムが好適である。

本発明で用いられる中和剤の量は、各中和剤によつて異なるものの、4-ヒドロキシケイ皮酸に対するモル比で1～2の範囲で用いるのが好ましい。中和は、通常、水中で行ない、例えばガラス電極によりpHを測定しつつ中和点を決定する方法によつて実施される。得られる中和水溶液のpHは4～8、特に6～7が好ましい。

本化粧料中の4-ヒドロキシケイ皮酸の配合量は、使用形態により変動しうるので、特に限定されず、有効量存在すればよいが、一般には化粧料組成物中0.1～20重量%、好ましくは0.5～15重量%となるようとする。

本発明化粧料は、前記の中和水溶液を用い

て常法により種々の形態とすることができますが、一般には、ローション状、乳液状、クリーム状、パック状、ゲル状等とするのが好ましい。これに適した基剤、溶剤としては、化粧料に通常配合して使用されている成分、例えば油性物質、保湿剤、増粘剤、防腐剤、乳化剤、美白成分、香料、乳化安定剤等を使用することができる。また、種々の有効成分としてアラントイン、ビタミンEアセテート、グリチルリチン、サリチル酸、尿素、各種植物抽出物質等を添加することにより、美白効果の向上をはかることができる。更に、種々の紫外線吸収物質を添加することによつて、日焼けの予防と美白効果を兼ね備えた化粧料とすることができます。

#### 〔作用〕

本発明に使用される中和剤である弱塩基性無機塩又は弱塩基性有機酸塩は、4-ヒドロキシケイ皮酸を安定に水に溶解する作用を有する。

また、4-ヒドロキシケイ皮酸は、311nmに分子吸光係数が24,000の極大吸収を示し、紫外線吸収作用を有する。

#### 〔発明の効果〕

本発明化粧料は、メラニン抑制作用を有する4-ヒドロキシケイ皮酸が大量かつ安定に配合されているため、優れた美白効果を有し、更に日焼け防止効果をも発揮できるものである。

#### 〔実施例〕

次に実施例を挙げて説明する。

#### 実施例1

第1表に示す中和剤で中和した4-ヒドロキシケイ皮酸の1重量%水溶液を調製し、50℃の恒温槽で保存後、4-ヒドロキシケイ皮酸の残存量を311nmでの吸光度の変化から調べた。その結果を第1表に示す。

第1表より、中和剤として弱塩基性無機塩及び弱塩基性有機酸塩が好適であることがわかる。

以下余白

第1表

中和剤	モル比	pH	4-ヒドロキシケイ皮酸残存率(%)		
			7日後	21日後	40日後
NaOH	1.0	6.9	9.3	8.0	6.5
アルギニン	1.0	7.6	9.3	8.0	6.5
トリエノールアミン	1.2	7.1	9.3	7.9	6.8
NaHCO <sub>3</sub>	1.0	7.0	9.7	8.6	7.3
Na <sub>2</sub> HPO <sub>4</sub>	1.5	6.6	9.6	8.7	7.7
K <sub>2</sub> HPO <sub>4</sub>	1.5	6.7	9.7	8.4	7.6
CH <sub>3</sub> COONa	2.0	6.1	9.4	9.0	8.2
クエン酸三カリウム	2.0	6.0	9.1	7.7	7.1

## 実施例2

化粧水：

(組成)

4-ヒドロキシケイ皮酸	5 %
リン酸水素二ナトリウム	6.5 %
グリセリン	4 %
ポリオキシエチレン(60)硬化ヒマン油	1 %
エタノール	5 %
防腐剤	適量
香料	微量
色素	微量
精製水	残量

## 実施例3

ジェル：

(組成)

4-ヒドロキシケイ皮酸	7 %	硬化バーム油	4 %
乳酸ナトリウム	7 %	ポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノステアレート	2 %
プロブレングリコール	8 %	ソルビタンモノステアレート	2 %
カルボキシビニルポリマー	0.5 %	グリセリン	3 %
ヒドロキシエチルセルロース	0.1 %	防腐剤	適量
精製水	残量	香料	微量
		精製水	残量

## 実施例4

O/W型クリーム：

(組成)

4-ヒドロキシケイ皮酸	10 %		
リン酸水素二カリウム	13 %	出願人	花王石鹼株式会社
ステアリン酸	2 %	代理人	弁理士 有賀 三幸
セタノール	4 %		弁理士 高野 登志雄
ワセリン	5 %		弁理士 小野 信夫
スクワラン	8 %		